(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum Internationales Büro



3 9 DEC 2004

(43) Internationales Veröffentlichungsdatum 15. Januar 2004 (15.01.2004)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer WO 2004/004729 A1

(51) Internationale Patentklassifikation⁷: A61K 31/496, A61P 25/00, C07D 333/70, 307/85, 345/00, 209/42, C07F 17/02

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2003/007060

(22) Internationales Anmeldedatum:

2. Juli 2003 (02.07.2003)

(25) Einreichungssprache:

Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache:

Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:

102 30 062.3

4. Juli 2002 (04.07.2002) DE

102 32 020.9

10. Juli 2002 (10.07.2002) DE

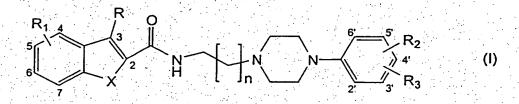
(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von US): FRIEDRICH-ALEXANDER-UNI VERSITÄT

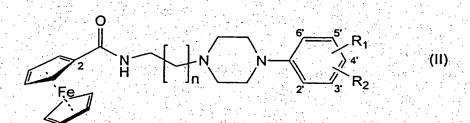
ERLANGEN-NÜRNBERG [DE/DE]; Schlossplatz 4, 91054 Erlangen (DE).

- (72) Erfinder; und
- (75) Erfinder/Anmelder (nur für US): GMEINER, Peter [DE/DE]; Sebalder Forstweg 24, 91054 Erlangen-Buckenhof (DE). HÜBNER, Harald [DE/DE]; Reuendorfer Weg 7, 91336 Heroldsbach (DE). SCHLOTTER, Karin [DE/DE]; Spitalgasse 5, 86732 Oettingen (DE).
- (74) Anwalt: HOFFMANN EITLE, Arabellastrasse 4, 81925 München (DE).
- (81) Bestimmungsstaaten (national): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP-KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK,

[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

- (54) Title: UTILIZATION OF HETEROARENE CARBOXAMIDE AS DOPAMINE-D3 LIGANDS FOR THE TREATMENT OF CNS DISEASES
- (54) Bezeichnung: HETEROARENCARBOXAMIDE ZUR VERWENDUNG ALS DOPAMIN-D3 LIGANDEN ZUR BEHAND-LUNG VON ZNS-ERKRANKUNGEN





(57) Abstract: The invention relates to neuroreceptor active N-[(4-phenyl-1-piperazinyl)alkyl]-substituted heteroarene carboxamide of general formula (I) and to structure analogous 2-ferrocenyl compounds of general formula (II) and the utilization thereof for the treatment of CNS diseases, for example, schizophrenia, different forms of depression, neurodegenerative disorders, sexual dysfunctions, cocaine, alcohol, opiate and nicotine addiction, in addition to glaucoma, cognitive disorders, restless leg syndrome, hyperactivity syndrome (ADHS), hyperprolactinemia, hyperprolactinoma, locomotion disorders associated with Parkinson's disease, treatment of L-DOPA and neuroleptic-induced locomotion disorders, for example, akathisia, rigor, dystonia and dyskinesia, wherein the substituents are defined in the description.

MN, MW, MX, MZ, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) Bestimmungsstaaten (regional): ARIPO-Patent (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL,

PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI-Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Veröffentlicht:

- mit internationalem Recherchenbericht

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der PCT-Gazette verwiesen.

(57) Zusammenfassung: Die vorliegende Erfindung betrifft neurorezeptoraktive N-[(4-Phenyl-1-piperazinyl)alkyl]-substituierte Heteroarencarboxamide der allgemeinen Formel (I) sowie strukturanaloge 2-Ferrocenylverbindungen der allgemeinen Formel (II) und ihre Verwendung zur Behandlung von ZNS-Erkrankungen, wie beispielsweise Schizophrenie, verschiedene Arten der Depression, neurodegenerative Störungen, sexuelle Dysfunktionen, Kokain-, Alkohol-, Opiat- und Nikotinsucht, sowie von Glaukoma, kognitiven Störungen, Restless Leg Syndrom, Hyperaktivitätssyndrom (ADHS), Hyperprolaktinämie, Hyperprolaktinom, Parkinson-assoziierten Bewegungsstörungen, Behandlung von L-DOPA und Neuroleptika-induzierten Bewegungsstörungen, z.B. Akathisie, Rigor, Dystonie und Dyskinesien, worin die Substituenten wie in der Beschreibung definiert sind.